(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



I CREAT BANKAN IN CACANO BARN BONK BAHRA BANK I NI BARN BARN BARNI CENDA INDOLORDA NATI BANKAN HORE INDI INDI

(43) 国際公開日 2005 年5 月6 日 (06.05.2005)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 2005/040181 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07H 1/02, 11/04, C12P 19/40

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/015712

(22) 国際出願日:

2004年10月22日(22.10.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ: 特願 2003-364013

2003年10月24日(24.10.2003) JF

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): ヤマサ 醤油株式会社 (YAMASA CORPORATION) [JP/JP]; 〒 2880056 千葉県銚子市新生町 2-1 0-1 Chiba (JP). (72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 山田 浩平 (YA-MADA, Kohei) [JP/JP]; 〒2880812 千葉県銚子市栄町2丁目1361-1 Chiba (JP). 松本 倫毅 (MAT-SUMOTO, Noritake) [JP/JP]; 〒5830862 大阪府羽曳野市尺度8-1 Osaka (JP). 早川 弘之 (HAYAKAWA, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒2880817 千葉県銚子市清川町4丁目8-8 Chiba (JP).

(74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT OFFICE); 〒1030013 東京都中央区日本橋人形町1丁目3番6号共同ビルTokyo (JP).

/続葉有/

(54) Title: α -1-PHOSPHORYLATED-2-DEOXY-2-FLUOROARABINOSIDE AND PROCESS FOR PRODUCING 2'-DEOXY-2'-FLUORO- β -D-ARABINONUCLEOSIDE

(54) 発明の名称: $\alpha-1$ -リン酸化 $2-\tilde{r}$ オキシー 2- フルオロアラビノシド及び $2'-\tilde{r}$ オシキー 2'- フルオロー $\beta-$ D-アラビノヌクレオシドの製造法

HO O OPO
$$_3H_2$$
F (V')

(57) Abstract: A process for producing a 2'-de-oxy-2'-fluoro- β -D-arabinonucleoside represented by the formula (II): (wherein B represents a base), characterized by causing nucleoside phosphorylase to act on either α -1-phosphorylated-2-deoxy-2-fluoroarabinoside, which is represented by the formula (I): or a mixture of the α - and β -isomers of 1-phosphorylated-2-deoxy-2-fluoroarabinoside, which are represented by the formula (V'): and on a base. Thus, the target compound, in particular,

which are represented by the formula (V'): and on a base. Thus, the target compound, in particular, 2'-deoxy-2'-fluoro- β -D-arabinopurine nucleoside, can be easily and highly stereoselectively produced in a high yield.

- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,

CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- -- 国際調査報告書
- 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領の際には再公開される。

2文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

式(I):

【化1】

で表されるα-1-リン酸化2-デオキシ-2-フルオロアラビノシド又は式(V'):

【化2】

HO O OPO₃H₂

$$F \qquad (V')$$

で表される1-リン酸化2-デオキシ-2-フルオロアラビノシドの α β 体混合物、及び塩基に、ヌ クレオシドホスホリラーゼを作用させることを特徴とする、式(II):

【化3】

(式中、Bは塩基を示す。)

で表される2'ーデオキシー2'ーフルオローβーDーアラビノヌクレオシド、特に2'ーデオキシー2'ーフルオローβーDーアラビノプリンヌクレオシドを簡便、かつ高立体選択的に高収率で製造できる